

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representation of
The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

⑨ 日本国特許庁 (JP) ⑩ 特許出願公開
 ⑪ 公開特許公報 (A) 昭55-124763

⑫ Int. Cl.³
 C 07 D 213/64
 213/70

識別記号 庁内整理番号
 7138-4C
 7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日
 発明の数 1
 審査請求 未請求

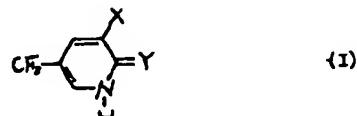
(全 3 頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体
 ⑮ 特 願 昭54-32068
 ⑯ 出 願 昭54(1979)3月19日
 ⑰ 発明者 西山隆三
 高槻市真上町5丁目41番22号
 ⑱ 発明者 藤川敢一
 守山市浮気町321番地の31
 ⑲ 発明者 横道歎
 草津市野村町221番地

⑳ 発明者 芳賀隆弘
 草津市野村町221番地
 ㉑ 発明者 長谷邦昭
 守山市浮気町321番地の31
 ㉒ 発明者 林弘仁
 守山市浮気町321番地の31
 ㉓ 出願人 石原産業株式会社
 大阪市西区江戸堀1丁目3番11
 号

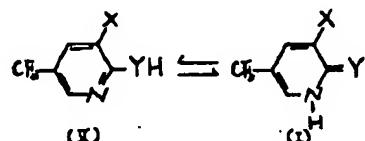
明細書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体



(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

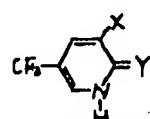
前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



(式中X及びYは前述の通りである)
 前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、氯素、溴素、碘素が用いられる。

2. 特許請求の範囲

1. 一般式



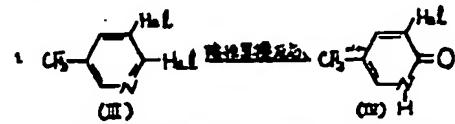
(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

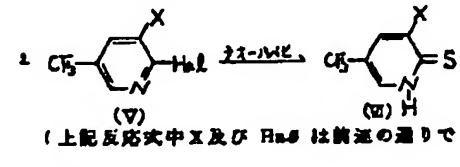
本発明は医薬、農薬、染料などの中间原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

詳しくは本発明は一般式

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ン誘導体は通¹、例えば下記方法によって製
造される。



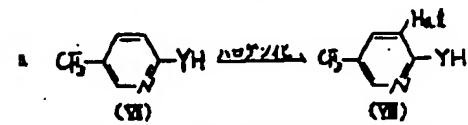
一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶
媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど
のフルカリ水溶液を用いて50~150°C、0.1
~10時間で行なわれる。



一般に上記反応はメタノール、エタノールな
どのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

- 3 -

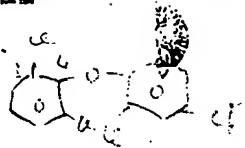
特開昭55-124763(2)
媒など、溶媒中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ
硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミ
ン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50~
還流温度0.5~1.0時間で行なわれる。



一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、
酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒
などの溶媒中、塩素ガス、臭素、チオニルクロ
ライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン
化剤を用いて0~100°C、0.5~1.0時間で
行なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベ
ンゼン類と結合させて4-(5-トリフルオロメ
チルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベン
ゼン類を生成させ、これを還元して得られる4
-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イ
ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアネ

- 4 -



死虫が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。
合成例 1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ビリドン

[A]

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン 0.
2g をクロロホルム 20mL に溶解させ、50
°C に加熱して塩素ガスを 1 時間搅拌下に通じ
た。反応終了後、クロロホルムを除去し、ト
ルエン-ヨウヘキサンの混合溶媒で再結晶し
て融点 144~147°C の目的物 0.15g を
得た。

[B]

水酸化ナトリウム 2.4g を水 125mL に溶
解させた水溶液に 2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルピリジン 4g を加え、更にジ
メチルスルホキシド 125mL を加えて加熱し、
110°C で 1 時間搅拌下に反応させた。反応
終了後生成物を冷却し、微粒で酸性にして
沈殿物を得、このものを通過して目的物 2.5

ト類とを反応させることにより N-ベンゾイ
ル-N'-(4-[5-トリフルオロメチルピリ
ジン-2-イルオキシ]フェニル)ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の 3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ドンと 2,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを
結合、還元して 3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと 2
,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾ
イル)-N'-(3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-
イルオキシ)フェニル)ウレアを得ることがで
きる。このものは農業用の有効成分として優れ
た活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆蟲の
防除に有効であって、例えばこの化合物 100
ppm 水分散液にキバウツの蟲片を浸漬し、それ
を風乾してそこへ 2~3 合のコナガの幼虫を放
ち、8 日目に生死を判定した結果、100% の

- 5 -

- 6 -

を得た。

合成例 2 5-トリフォルオロメチル-2-チオ
ビリドン

2-クロロ-5-トリフォルオロメチルヒリ
ジン4タとチオ尿素167タとをエタノール
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液123タを徐々に加えて還流状態
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点147~150℃の目的物
2.1タを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフォルオロメチ
ル-2-ビリドン

5-トリフォルオロメチル-2-ビリドン0.
4タを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.
4タを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

特許55-124783(3)

反応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン~
ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点162
~165℃の目的物0.45タを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフォルオロメチ
ル-2-チオビリドン

2-クロロ-5-トリフォルオロメチルヒリ
ジン4タに代えて2,3-ジクロロ-5-トリフォ
ルオロメチルヒリジン4.75タを用いる以外
は前記合成例2と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点125~128℃の目
的物1.9タを得た。

特許出願人 石原産業株式会社